

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
30. Juni 2005 (30.06.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/058904 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04,  
A01N 43/90

Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilius [GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr.1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE]; Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251 Freinsheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/014210

(22) Internationales Anmeldedatum:  
14. Dezember 2004 (14.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10359452.3 17. Dezember 2003 (17.12.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach (DE). BLETTNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288

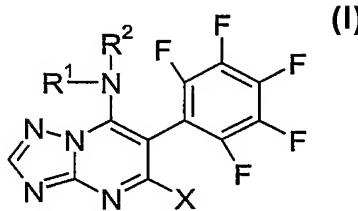
(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF Aktiengesellschaft; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 6-PENTAFLUOROPHENYL-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION AND THEIR USE FOR COMBATING PATHOGENIC FUNGI, IN ADDITION TO AGENTS CONTAINING SAID SUBSTANCES

(54) Bezeichnung: 6-PENTAFLUOROPHENYL-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract: 6-pentafluorophenyl-triazolopyrimidines of formula (I), in which the substituents are defined as follows: R<sup>1</sup> represents alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S; R<sup>2</sup> represents hydrogen or one of the groups cited for R<sup>1</sup>; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, together with the nitrogen atom, to which they are bonded, can also form a five- or six-membered heterocycl or heteroaryl, which is bonded via N and can contain one to three additional heteroatoms from the groups O, N and S as a ring member; R<sup>1</sup> and/or R<sup>2</sup> can be substituted in accordance with the description; X represents cyano, alkyl, alkoxy, alkenyloxy, haloalkoxy or haloalkenyloxy. The invention also relates to methods for

producing said compounds, to agents containing the latter and to their use for combating plant-pathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: 6-Pentafluorophenyl-triazolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup> Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogencycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogencycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder eine der bei R<sup>1</sup> genannten Gruppen, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten kann; R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> können gemäß der Beschreibung substituiert sein; X Cyano, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkoxy oder Halogenalkenyloxy. Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2005/058904 A1



KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,

PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

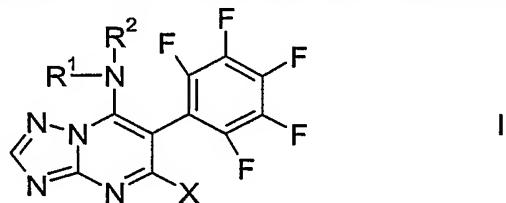
- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

6-Pentafluorphenyl-triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 6-Pentafluorphenyl-triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

$R^1$  C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

$R^2$  Wasserstoff oder eine der bei  $R^1$  genannten Gruppen,

$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

$R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

$R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, ali-

cyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

5 X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy.

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

10 5-Halogen-6-Pentafluor-triazolopyrimidine sind aus EP-A 834 513 allgemein bekannt. 5-Cyano- und 5-Alkoxy-triazolopyrimidine sind in WO 02/083677 offenbart. Triazolopyrimidine mit optisch aktiven Aminosubstituenten in 7-Position werden in WO 02/38565 allgemein vorgeschlagen.

15 20 Die in den vorgenannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignet.

25 Ihre Wirkung ist jedoch nicht immer in jeder Hinsicht völlig zufriedenstellend. Davon ausgehend liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

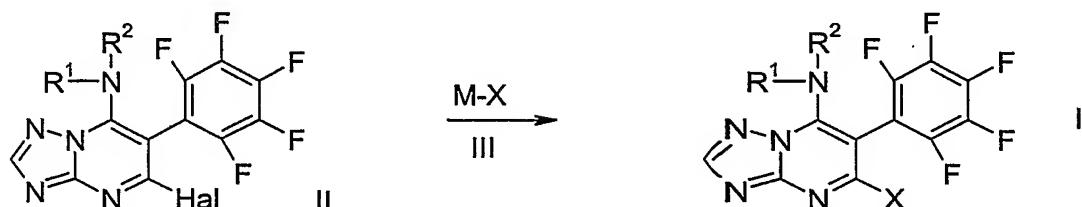
Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des Weiteren wurde ein Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in der vorgenannten Schrift beschriebenen durch die Substitution in der 5-Position des Triazolopyrimidin-Gerüstes.

30 35 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit, bzw. ein verbreiteretes Wirkungsspektrum gegen Schadpilze auf.

40 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie ausgehend von den aus EP-A 834 513 bekannten 5-Halogen-6-pentafluorphenyl-triazolopyrimidinen der Formel II durch Umsetzung mit Verbindungen M-X (Formel III) erhalten. Verbindungen III stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel III hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicher-

weise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C

5 [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

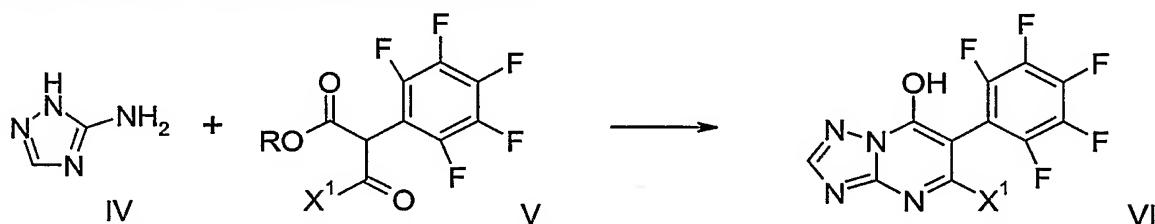
Sofern R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet, wird vorteilhaft vor Umsetzung mit III eine abspaltbare Schutzgruppe eingeführt [vgl. Greene, Protective Groups in Organic Chemistry, J. Wiley & Sons, (1981)].

10

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, Alkohole, wie Methanol oder Ethanol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol oder Acetonitril.

15

Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:



Ausgehend von 2-Aminotriazol IV und Ketoestern V, wobei R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VI erhalten. In Formeln V und VI steht X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-

20 Phenylacetessigestern (V mit X<sup>1</sup>=CH<sub>3</sub>) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten, die einen bevorzugten Gegenstand der Erfindung darstellen [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. 2-Aminotriazol IV ist kommerziell erhältlich.

Die Herstellung der Ausgangsverbindungen V erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10

25

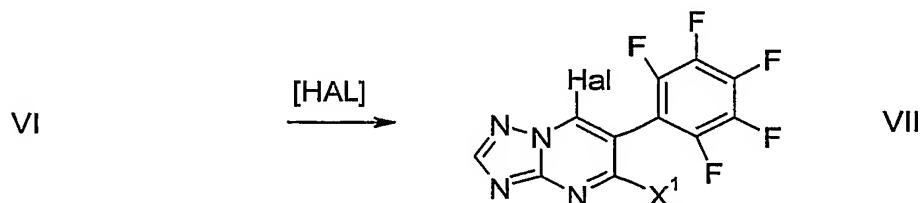
02 788 beschrieben Bedingungen.

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungs-mitteln [HAL] unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Halogenpyrimidine der Formel VII überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein

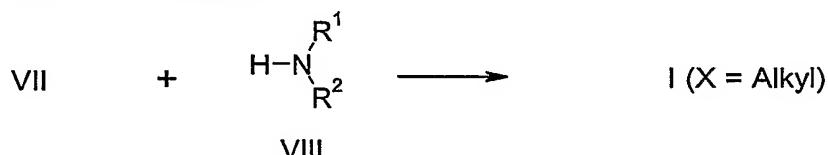
30

Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungs-mittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoro-

xybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt.



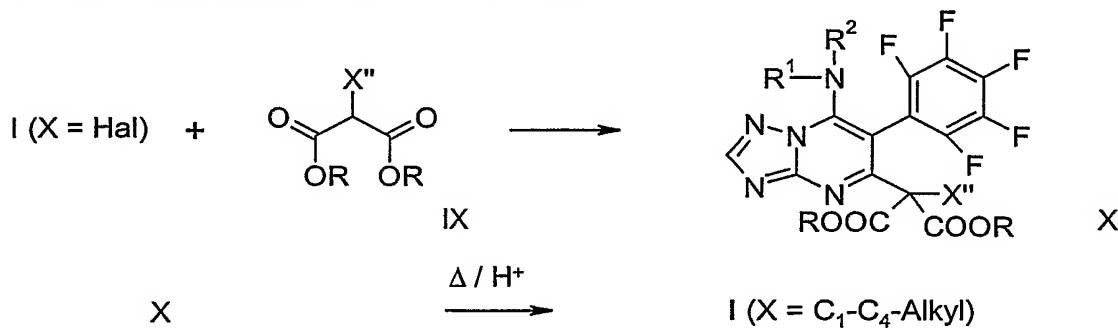
Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, 5 durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].



Die Umsetzung von VII mit Aminen VIII, wobei R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie in Formel I definiert sind, wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder 10 insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder an-15 organische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VIII kann als Base dienen.

Verbindungen der Formel I, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der 20 Formel IX hergestellt werden. In Formel IX bedeuten X" Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel X umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].



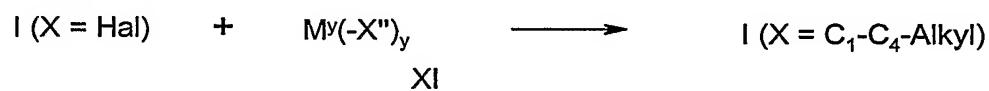
Die Malonate IX sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); 25 J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder kön-nen gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschließende Verseifung des Esters X erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen X vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

10 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe  
 15 wie Methylchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20 Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel XI erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



30 In Formel XI steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

35 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder

schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter verminderter Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

5

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

10 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in 15 der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

20 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

30

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlor-

35

methyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butene, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butene, 1,1-Dimethyl-3-butene, 1,2-Dimethyl-1-butene, 1,2-Dimethyl-2-butene, 1,3-Dimethyl-3-butene, 2,2-Dimethyl-3-butene, 2,3-Dimethyl-1-butene, 2,3-Dimethyl-2-butene, 1-Ethyl-1-butene, 1-Ethyl-2-butene, 1-Ethyl-3-butene, 2-Ethyl-1-butene, 2-Ethyl-2-butene, 2-Ethyl-3-butene, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise 25 oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 30 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-1-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

5    fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder 10    Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-15    yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran, 4-Tetrahydropyran, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;

20    -    5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazoly, 4-Pyrazoly, 5-Pyrazoly, 2-Oxazoly, 4-Oxazoly, 5-Oxazoly, 2-Thiazoly, 4-Thiazoly, 5-Thiazoly, 2-Imidazoly, 4-Imidazoly, und 1,3,4-Triazol-2-yl;

- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;

35    Alkylen: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, welche über eine Doppelbindung an das Gerüst gebunden sind, z. B. =CH<sub>2</sub>, =CH-CH<sub>3</sub>, =CH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

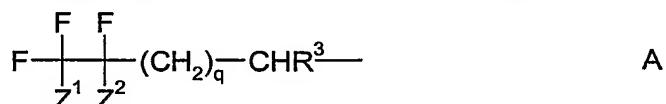
40    Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

5 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

10 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe A steht:



worin

15 Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,

Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder

Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

q 0 oder 1 ist; und

20 R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

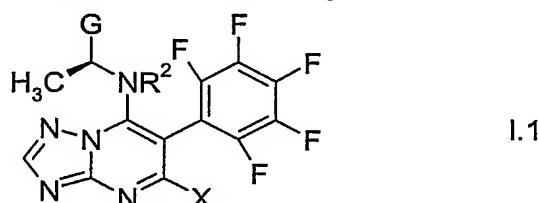
Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

25 Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

30 Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)-Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



in der

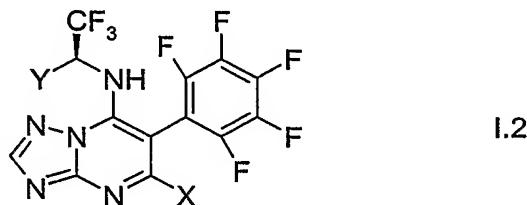
G C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

5 R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; und

X wie für Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der

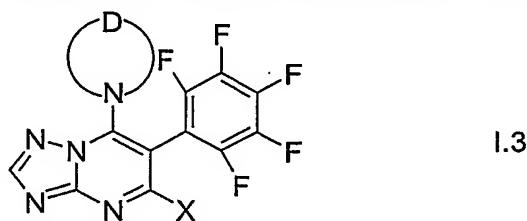
10 Formel I.2.



in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X wie für Formel I definiert sind, insbesondere für Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

15 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,

20 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.3,



in der

25 D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,

30 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann; und

X wie für Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem

5 Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morphinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinylring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

10

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert

15

ist.

Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup>CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- bedeuten.

Weiterhin werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X Cyano, Methoxy oder Ethoxy, insbesondere Cyano oder Methoxy bedeutet.

25

In einer anderen bevorzugten Ausführungsform der Verbindungen I bedeutet X Methyl.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten

30 genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

#### Tabelle 1

35 Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

#### Tabelle 2

40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle A

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-1	CH <sub>3</sub>	H
A-2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-3	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-7	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-8	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-9	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
A-10	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-11	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-12	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-19	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-20	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-24	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-25	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-26	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-27	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-28	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-29	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-30	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-31	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-32	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-33	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-34	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-35	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-36	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-37	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-38	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-39	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-40	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-42	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-43	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-44	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-45	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-46	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-47	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-48	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-49	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-50	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-51	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-52	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-53	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-54	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-56	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-57	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-58	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-60	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-61	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-62	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-63	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-65	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-66	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-67	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-69	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-70	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-71	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-73	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-74	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-75	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-77	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-78	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-79	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-80	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-81	CH <sub>2</sub> -C≡CH	H
A-82	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>3</sub>
A-83	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-84	Cyclopentyl	H
A-85	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-86	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-87	Cyclohexyl	H
A-88	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-89	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-90	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
A-91	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
A-92	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-94	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-96	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
A-97	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-98	-CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-99	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-100	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-102		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
A-103		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-104		-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -
A-105		-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
A-106		-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-107		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-
A-108		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-109		-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
A-110		-(CH <sub>2</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -
A-111		-CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-112		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-113		-(CH <sub>2</sub> )-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-114		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -
A-115		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
A-116		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-117		-N=CH-CH=CH-
A-118		-N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-
A-119		-N=C(CF <sub>3</sub> )-CH=C(CF <sub>3</sub> )-

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

5 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

10 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

15 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,

• *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,

• *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,

• *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,

• *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,

20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,

- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,

5     • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,

- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,

10    • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,

- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

15    Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

20    Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

25    Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

30    Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis 1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g je 100 Kilogramm Saatgut benötigt.

35    Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die An-

wendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

5 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfractionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butryolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talcum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylenfettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

10 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfinsäure, Naphthalinsulfinsäure, Phenolsulfinsäure, Dibutylnaphthalinsulfinsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des

15 Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfinsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

20

25

30

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

5 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

10 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

20 A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

25 B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

30 C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

35 D Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

## E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer

5 Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

## F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Disper-

10 gier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lö-

sung des Wirkstoffs.

## 15 G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirk-

stoffs.

20

## 2. Produkte für die Direktapplikation

## H Stäube (DP)

5 Gew. Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 %

25 feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

## I Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die

30 Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

## J ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen

35 Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern,

40 Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,

Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

5

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

10

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

15

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

20

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

25

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

30

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

35

40 • Acylalanine wie Benalaxyd, Metalaxyd, Ofurace, Oxadixyl,

- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- 5 • Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 10 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimoi, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenoxy, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- 15 • Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 20 • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Dicloctemet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- 25 • Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 30 • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

#### Synthesebeispiele

35 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1 – Herstellung von 5-Cyano-6-pentafluorphenyl-7-diethylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

3,4 g (8,6 mmol) 5-Chlor-6-pentafluorphenyl-7-diethylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin und 3,2 g (20 mmol) Tetraethylammoniumcyanid in 30 ml Dimethylformamid wurden etwa 45 min bei 20-25°C gerührt. Nach Verdünnen der Reaktionsmischung mit Wasser wurde die wässrige Phase mit Methyl-t-butylether extrahiert, die vereinigten organischen Phasen nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester-Gemische) erhielt man aus dem Rückstand 10 0,7 g der Titelverbindung als farblose Kristallmasse vom Fp. 153-158°C.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  in ppm): 8,55 (s, 1H); 3,55 (q, 4H); 1,2 (t, 6H)

Beispiel 2 - Herstellung von 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-

15 1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Stufe 2a: 2-Pentafluorphenyl-acetessigsäure-ethylester (Formel V)

Eine Lösung von 14,1 g (0,102 mol) Kaliumcarbonat, 13 g (0,1 mol) Acetessigsäureethylester und 20 g (0,108 mol) Hexafluorbenzol in 100 ml Dimethylformamid (DMF) wurden ca. 5 Std. bei 60°C gerührt. Anschließend wurde die auf 20-25°C gekühlte Reaktionsmischung und auf eine Mischung von 30 ml konz. Salzsäure in 700 ml Wasser gegossen. Nach Extraktion der wässrigen Phase mit Methyl-t-butylether (MTBE) wurden die vereinigten organischen phasen getrocknet und vom Lösungsmittel befreit.

25 Nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan) wurden 7,3 g der Titelverbindung als helles Öl erhalten.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  in ppm): 13,4 (s, 1H); 4,2 (q, 2H); 1,9 (s, 3H); 1,2 (t, 3H).

30 Stufe 2b: 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-hydroxy-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (Formel VI)

Eine Lösung von 20 g (67 mmol) 2-Pentafluorphenyl-acetessigsäure-ethylester (aus Bsp. 2a) und 5,7 g (67 mmol) Aminotriazol in 67 ml Propionsäure wurden ca. 15 Std. 35 refluxiert. Anschließend kühlte man auf 20-25°C ab, destillierte die flüchtigen Bestandteile ab und digerierte den Rückstand in Wasser. Der ausgefallene Niederschlag wurde abfiltriert und in Essigsäureethylester aufgenommen. Die organische Phase wurde mit verd. Salzsäure gewaschen, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Der Rückstand kristallisierte und wurde in Hexan digeriert. Es blieben 8 g eines farblosen Festkörpers 40 zurück, der die Titelverbindung 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-hydroxy-1,2,4-

triazolo[1,5a]pyrimidin sowie das Isomere 7-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-5-hydroxy-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin im Verhältnis 1:2 (gemäß  $^1\text{H-NMR}$ ) enthielt.

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>,  $\delta$  in ppm):

5 5-Methyl,7-Hydroxy-Isomer: 8,4 (s, 1H); 2,25 (s, 3H).  
5-Hydroxy,7-Methyl-Isomer: 8,25 (s, 1H); 2,5 (s, 3H).

Stufe 2c: 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-chlor-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (Formel VII)

10 7 g des Produktgemischs aus Beispiel 2b und drei Tropfen DMF in 24 ml Phosphoroxychlorid wurden ca. 4 Stunden refluxiert. Nach Abkühlen wurde die Reaktionsmis-  
schung von den flüchtigen Bestandteilen befreit. Der Rückstand wurde in 70 ml Methy-  
lenchlorid und 30 ml Wasser aufgenommen, wobei das Methylenchlorid zu sieden be-  
15 gann. Nach Phasentrennung wurde die wässrige Phase mit Methylenchlorid extrahiert.  
Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit.  
Nach Chromatographie an Kieselgel (MTBE) erhielt man 4,7 g eines weißen Festkör-  
pers, der die Titelverbindung 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-chlor-1,2,4-  
triazolo[1,5a]pyrimidin sowie das Isomere 7-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-5-chlor-1,2,4-  
20 triazolo[1,5a]pyrimidin im Verhältnis 4:1 (gemäß  $^1\text{H-NMR}$ ) enthielt.

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>,  $\delta$  in ppm):

5-Methyl,7-chlor-Isomer: 8,9 (s, 1H); 2,75 (s, 3H).  
5-Chlor,7-methyl-Isomer: 8,85 (s, 1H); 2,5 (s, 3H).

25 Stufe 2d: 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-  
triazolo[1,5a]pyrimidin (Formel I)

Eine Lösung von 1 g 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-chlor-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin  
30 (aus Beispiel 2c) und 0,33 g 4-Methylpiperidin in 6 ml Butanol wurden 1 Std. bei 90°C  
gerührt. Nach Abkühlen auf 20-25°C wurden die flüchtigen Bestandteile abdestilliert.  
Der Rückstand wurde in Essigsäureethylester aufgenommen, die organische Phase  
mit Wasser extrahiert, getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand  
wurden nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan-Essigester-Gemische) 0,9 g  
35 der Titelverbindung 5-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-  
triazolo[1,5a]pyrimidin zusammen mit dem Isomeren 7-Methyl-6-(pentafluorphenyl)-5-  
(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin im Verhältnis 5:1 (gemäß  $^1\text{H-NMR}$ )  
erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>,  $\delta$  in ppm): 8,3 (s, 1H); 3,7 (d, breit, 2H); 2,8 (t, breit, 2H); 2,55 (s, 3H); 1,6 (m, 2H); 1,35 (m, 1H); 1,0 (m, 2H); 0,9 (d, 3H).

Tabelle I – Verbindungen der Formel I

5

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Phys. Daten ( <sup>1</sup> H-NMR [ $\delta$ ppm]; Fp. [°C])
I-1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		CN	181-185
I-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN	153-158
I-3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub>	(s. Bsp. 2d)
I-4	-CH <sub>2</sub> -C(=CH <sub>2</sub> )-CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8,25 (s); 2,5 (s); 1,15 (t)
I-5	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	8,2 (s); 2,5 (s); 1,2 (d)

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden

10 Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) 15 zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres* bei protektiver Anwendung

20 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte „Hanna“ wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die 25 Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindung I-3 behandelten Pflanzen nur 5 30 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter 5 gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inkuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und 10 hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, I-3, bzw. I-4 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

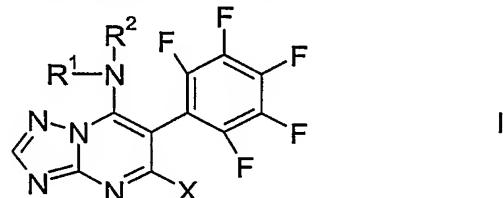
15 Anwendungsbeispiel 3 - Protektive Wirksamkeit gegen die Septoria-Blattfleckenkrankheit des Weizens verursacht durch *Septoria tritici*

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizenkeimlingen der Sorte "Riband" wurden mit 20 wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden sie mit einer wässrigen Sporensuspension von *Septoria tritici* inkuliert. Die Suspension enthielt  $2,0 \times 10^6$  Sporen/ml. Die Versuchspflanzen wurden anschließend im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 18 und 22°C und einer relativen 25 Luftfeuchtigkeit nahe 100 % aufgestellt. Nach 2 Wochen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, I-4, bzw. I-5 behandelten Pflanzen nicht über 5 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 30 % befallen waren.

## Patentansprüche

## 1. 6-Pentafluorphenyl-triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10  $R^1$  C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15  $R^2$  Wasserstoff oder eine der bei  $R^1$  genannten Gruppen,

20 25  $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteraryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

30 35  $R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

$R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder

aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

5        X     Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy.

10      2.    Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy bedeutet.

15      3.    Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Cyano bedeutet.

20      4.    Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Methoxy bedeutet.

25      5.    Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet.

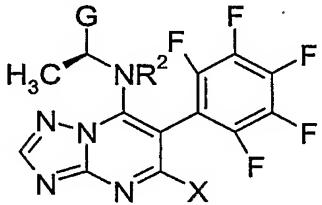
30      6.    Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> folgende Bedeutung haben:

20      R<sup>1</sup>    CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> , CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> , CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> , CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub> , CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub> , CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub> , Cyclopentyl , Cyclohexyl;

25      R<sup>2</sup>    Wasserstoff oder Methyl; oder

30      R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bilden gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- , -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

7.    Verbindungen der Formel I.1:


I.1

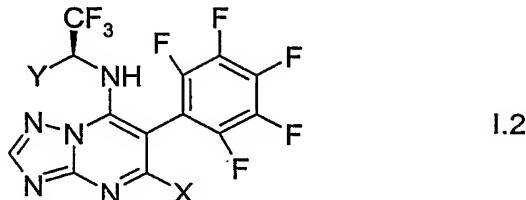
30      in der

    G    C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;

    R<sup>2</sup>    Wasserstoff oder Methyl; und

    X    Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

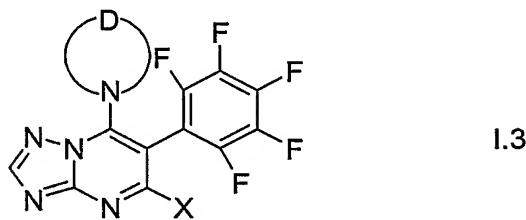
## 8. Verbindungen der Formel I.2.



in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und X für Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

5

## 9. Verbindungen der Formel I.3,

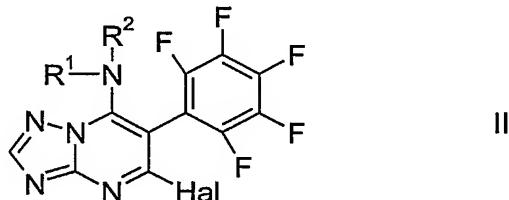


in der

10 D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteraryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann; und

15 X Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

20 10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 2, durch Umsetzung von 5-Halogen-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II



in der Hal für ein Halogenatom steht, mit Verbindungen der Formel III

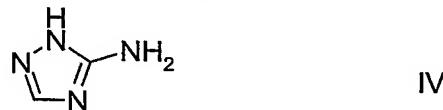
25

M-X

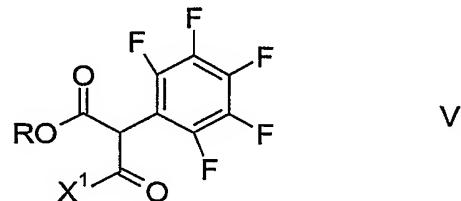
III

in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall-Kation steht und X die Bedeutung gemäß Anspruch 2 hat.

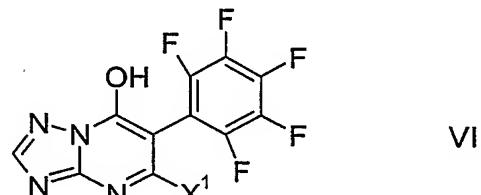
11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 5, durch Umsetzung von 2-Aminotriazol der Formel IV



5 mit Ketoestern der Formel V,

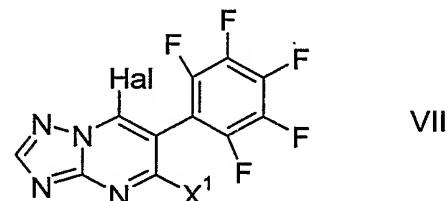


in der R und X<sup>1</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten und L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup> und L<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel VI,



10

Halogenierung von VI mit Halogenierungsmitteln zu Halogenpyrimidinen der Formel VII,



15

in der Hal für ein Halogenatom steht, und Umsetzung von VII mit Aminen der Formel VIII,



in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die Bedeutung wie in Formel I haben.

20

12. Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.

13. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 1 bis 1000 g/100 kg

14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 behandelt.

5

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2004/014210

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, PAJ, WPI Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category <sup>o</sup>	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 994 360 A (PFRENGLE ET AL) 30 November 1999 (1999-11-30) the whole document -----	1,5-7, 12,14
X	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16 May 2002 (2002-05-16) cited in the application the whole document -----	1-7,12, 14
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 8 April 1998 (1998-04-08) the whole document -----	1-14
Y	US 5 965 561 A (PEES ET AL) 12 October 1999 (1999-10-12) the whole document -----	1-14
		-/-

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

<sup>o</sup> Special categories of cited documents :

- <sup>\*A\*</sup> document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- <sup>\*E\*</sup> earlier document but published on or after the international filing date
- <sup>\*L\*</sup> document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- <sup>\*O\*</sup> document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- <sup>\*P\*</sup> document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

<sup>\*T\*</sup> later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

<sup>\*X\*</sup> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

<sup>\*Y\*</sup> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

<sup>\*&\*</sup> document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 April 2005

Date of mailing of the international search report

11/05/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Zellner, A

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2004/014210

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 071 792 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16 February 1983 (1983-02-16) the whole document -----	1-14
Y	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24 October 2002 (2002-10-24) cited in the application the whole document -----	1-14
Y	WO 03/093271 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 13 November 2003 (2003-11-13) the whole document -----	1-14
P, X	WO 2004/087705 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14 October 2004 (2004-10-14) the whole document -----	1-14
P, X	WO 2004/087706 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14 October 2004 (2004-10-14) the whole document -----	1-14
P, Y	WO 2004/058765 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; MUELLER, BERND; TORMO I BLASCO, JORDI; GROTE,) 15 July 2004 (2004-07-15) the whole document -----	1-14

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014210

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
US 5994360	A	30-11-1999	NONE		
WO 0238565	A	16-05-2002	AU 2183102 A WO 0238565 A2 EP 1368351 A2 JP 2004513170 T US 2004110771 A1		21-05-2002 16-05-2002 10-12-2003 30-04-2004 10-06-2004
EP 0834513	A	08-04-1998	US 5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A US 5965561 A		06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998 12-10-1999
US 5965561	A	12-10-1999	US 5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A		06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998
EP 0071792	A	16-02-1983	DE 3130633 A1 AT 11539 T AU 553663 B2 AU 8665982 A CA 1180329 A1 CS 226748 B2 DD 202093 A5 DE 3262143 D1 DK 341682 A, B, EP 0071792 A2 GR 76193 A1 HU 188325 B IE 53269 B1 JP 1634879 C JP 2061955 B JP 58043974 A US 4567263 A ZA 8205498 A		17-02-1983 15-02-1985 24-07-1986 10-02-1983 01-01-1985 16-04-1984 31-08-1983 14-03-1985 02-02-1983 16-02-1983 03-08-1984 28-04-1986 28-09-1988 20-01-1992 21-12-1990 14-03-1983 28-01-1986 27-07-1983
WO 02083677	A	24-10-2002	AT 274518 T DE 60201089 D1 DE 60201089 T2 WO 02083677 A1 EP 1381610 A1 ES 2225784 T3 JP 2004526767 T US 2004110751 A1		15-09-2004 30-09-2004 30-12-2004 24-10-2002 21-01-2004 16-03-2005 02-09-2004 10-06-2004
WO 03093271	A	13-11-2003	AU 2003232227 A1 BR 0309637 A CA 2482809 A1 WO 03093271 A1 EP 1504009 A1		17-11-2003 08-03-2005 13-11-2003 13-11-2003 09-02-2005
WO 2004087705	A	14-10-2004	WO 2004087705 A1		14-10-2004

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014210

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 2004087706	A	14-10-2004	WO	2004087706 A1		14-10-2004
WO 2004058765	A	15-07-2004	AU	2003296662 A1		22-07-2004
			WO	2004058765 A1		15-07-2004

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/014210

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, PAJ, WPI Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie <sup>a</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 994 360 A (PFRENGLE ET AL) 30. November 1999 (1999-11-30) das ganze Dokument	1,5-7, 12,14
X	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002 (2002-05-16) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-7,12, 14
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 8. April 1998 (1998-04-08) das ganze Dokument	1-14
Y	US 5 965 561 A (PEES ET AL) 12. Oktober 1999 (1999-10-12) das ganze Dokument	1-14
		-/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- <sup>a</sup> Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

29. April 2005

11/05/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,-  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Zellner, A

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014210

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 071 792 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16. Februar 1983 (1983-02-16) das ganze Dokument -----	1-14
Y	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-14
Y	WO 03/093271 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 13. November 2003 (2003-11-13) das ganze Dokument -----	1-14
P, X	WO 2004/087705 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14. Oktober 2004 (2004-10-14) das ganze Dokument -----	1-14
P, X	WO 2004/087706 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14. Oktober 2004 (2004-10-14) das ganze Dokument -----	1-14
P, Y	WO 2004/058765 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; MUELLER, BERND; TORMO I BLASCO, JORDI; GROTE,) 15. Juli 2004 (2004-07-15) das ganze Dokument -----	1-14

**INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014210

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 5994360	A	30-11-1999	KEINE		
WO 0238565	A	16-05-2002	AU 2183102 A WO 0238565 A2 EP 1368351 A2 JP 2004513170 T US 2004110771 A1		21-05-2002 16-05-2002 10-12-2003 30-04-2004 10-06-2004
EP 0834513	A	08-04-1998	US 5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A US 5965561 A		06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998 12-10-1999
US 5965561	A	12-10-1999	US 5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A		06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998
EP 0071792	A	16-02-1983	DE 3130633 A1 AT 11539 T AU 553663 B2 AU 8665982 A CA 1180329 A1 CS 226748 B2 DD 202093 A5 DE 3262143 D1 DK 341682 A ,B, EP 0071792 A2 GR 76193 A1 HU 188325 B IE 53269 B1 JP 1634879 C JP 2061955 B JP 58043974 A US 4567263 A ZA 8205498 A		17-02-1983 15-02-1985 24-07-1986 10-02-1983 01-01-1985 16-04-1984 31-08-1983 14-03-1985 02-02-1983 16-02-1983 03-08-1984 28-04-1986 28-09-1988 20-01-1992 21-12-1990 14-03-1983 28-01-1986 27-07-1983
WO 02083677	A	24-10-2002	AT 274518 T DE 60201089 D1 DE 60201089 T2 WO 02083677 A1 EP 1381610 A1 ES 2225784 T3 JP 2004526767 T US 2004110751 A1		15-09-2004 30-09-2004 30-12-2004 24-10-2002 21-01-2004 16-03-2005 02-09-2004 10-06-2004
WO 03093271	A	13-11-2003	AU 2003232227 A1 BR 0309637 A CA 2482809 A1 WO 03093271 A1 EP 1504009 A1		17-11-2003 08-03-2005 13-11-2003 13-11-2003 09-02-2005
WO 2004087705	A	14-10-2004	WO 2004087705 A1		14-10-2004

**INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014210

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2004087706 A	14-10-2004	WO 2004087706 A1	14-10-2004
WO 2004058765 A	15-07-2004	AU 2003296662 A1 WO 2004058765 A1	22-07-2004 15-07-2004